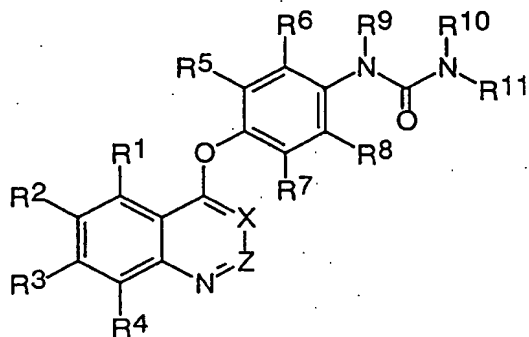




<p>(51) 国際特許分類7 C07D 215/22, 239/96, 401/12, 403/12, A61P 35/00, A61K 31/47, 31/4725, 31/496, 31/517, 31/5355</p>	<p>A1</p>	<p>(11) 国際公開番号 WO00/43366</p> <p>(43) 国際公開日 2000年7月27日(27.07.00)</p>												
<p>(21) 国際出願番号 PCT/JP00/00255</p> <p>(22) 国際出願日 2000年1月20日(20.01.00)</p> <p>(30) 優先権データ</p> <table border="0"> <tr> <td>特願平11/14858</td> <td>1999年1月22日(22.01.99)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平11/26691</td> <td>1999年2月3日(03.02.99)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平11/142493</td> <td>1999年5月21日(21.05.99)</td> <td>JP</td> </tr> <tr> <td>特願平11/253624</td> <td>1999年9月7日(07.09.99)</td> <td>JP</td> </tr> </table> <p>(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について) 麒麟麦酒株式会社 (KIRIN BEER KABUSHIKI KAISHA)[JP/JP] 〒104-8288 東京都中央区新川二丁目10番1号 Tokyo, (JP)</p> <p>(72) 発明者; および</p> <p>(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ) 久保和生(KUBO, Kazuo)[JP/JP] 〒370-0852 群馬県高崎市市中居町4-17-9 麒麟中居寮207号室 Gumma, (JP) 藤原康成(FUJIWARA, Yasunari)[JP/JP] 〒370-1202 群馬県高崎市宮原町12-210 Gumma, (JP) 磯江敏幸(ISOE, Toshiyuki)[JP/JP] 〒370-1206 群馬県高崎市台新田町330-28 Gumma, (JP)</p>		特願平11/14858	1999年1月22日(22.01.99)	JP	特願平11/26691	1999年2月3日(03.02.99)	JP	特願平11/142493	1999年5月21日(21.05.99)	JP	特願平11/253624	1999年9月7日(07.09.99)	JP	<p>(74) 代理人 佐藤一雄, 外(SATO, Kazuo et al.) 〒100-0005 東京都千代田区丸の内三丁目2番3号 富士ビル323号 協和特許法律事務所 Tokyo, (JP)</p> <p>(81) 指定国 AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, 欧州特許 (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), ARIPO特許 (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM)</p> <p>添付公開書類 国際調査報告書</p>
特願平11/14858	1999年1月22日(22.01.99)	JP												
特願平11/26691	1999年2月3日(03.02.99)	JP												
特願平11/142493	1999年5月21日(21.05.99)	JP												
特願平11/253624	1999年9月7日(07.09.99)	JP												
<p>(54) Title: QUINOLINE DERIVATIVES AND QUINAZOLINE DERIVATIVES</p> <p>(54) 発明の名称 キノリン誘導体およびキナリゾン誘導体</p> <div style="text-align: center;"> <p>(I)</p> </div> <p>(57) Abstract</p> <p>Compounds having an antitumor activity and causing no morphological change in cells. Compounds of general formula (I), pharmaceutically acceptable salts of them and solvates thereof, and medicinal compositions containing the same. In formula (I), X and Z represent each CH or N; R<sup>1-3</sup> represent each H, optionally substituted alkoxy, etc.; R<sup>4</sup> represents H; R<sup>5-8</sup> represent each H, halogeno, alkyl, alkoxy, alkylthio, nitro or amino, provided that all of R<sup>5-8</sup> do not represent H simultaneously; R<sup>9</sup> and R<sup>10</sup> represent each H, alkyl or alkylcarbonyl; and R<sup>11</sup> represents alkyl, alkenyl, alkynyl or aralkyl.</p>														

(57)要約

本発明は抗腫瘍活性を有しかつ細胞形態変化を生じさせない化合物の提供をその目的とする。式(I)の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物並びにこの化合物を含む医薬組成物が開示される。



(I)

(XおよびZはCHまたはNを表し、R<sup>1</sup>はH、置換アルコキシ、非置換アルコキシ等を表し、R<sup>2</sup>はHを表し、R<sup>3</sup>はH、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ニトロまたはアミノを表すが、R<sup>3</sup>が総てHを表すことはなく、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>はH、アルキル、アルキルカルボニルを表し、R<sup>6</sup>はアルキル、アルケニル、アルキニルまたはアラルキルを表す)

PCTに基づいて公開される国際出願のパンフレット第一頁に掲載されたPCT加盟国を同定するために使用されるコード(参考情報)

AE	アラブ首長国連邦	DM	ドミニカ	KZ	カザフスタン	RU	ロシア
AG	アンティグア・バーブーダ	DZ	アルジェリア	LC	セントルシア	SD	スーダン
AL	アルバニア	EE	エストニア	LI	リヒテンシュタイン	SE	スウェーデン
AM	アルメニア	ES	スペイン	LK	スリ・ランカ	SG	シンガポール
AT	オーストリア	FI	フィンランド	LR	リベリア	SI	スロヴェニア
AU	オーストラリア	FR	フランス	LS	レソト	SK	スロヴァキア
AZ	アゼルバイジャン	GA	ガボン	LT	リトアニア	SL	シエラ・レオネ
BA	ボスニア・ヘルツェゴビナ	GB	英国	LU	ルクセンブルグ	SN	セネガル
BB	バルバドス	GD	グレナダ	LV	ラトヴィア	SZ	スワジランド
BE	ベルギー	GE	グルジア	MA	モロッコ	TD	チャード
BF	ブルキナ・ファソ	GH	ガーナ	MC	モナコ	TG	トーゴ
BG	ブルガリア	GM	ガンビア	MD	モルドヴァ	TJ	タジキスタン
BJ	ベナン	GN	ギニア	MG	マダガスカル	TM	トルクメニスタン
BR	ブラジル	GR	ギリシャ	MK	マケドニア旧ユーゴスラヴィア共和国	TR	トルコ
BY	ベラルーシ	GW	ギニア・ビサウ	ML	マリ	TT	トリニダード・トバゴ
CA	カナダ	HR	クロアチア	MR	モーリタニア	TZ	タンザニア
CF	中央アフリカ	HU	ハンガリー	MN	モンゴル	UG	ウガンダ
CG	コンゴ	ID	インドネシア	MR	モーリタニア	US	米国
CH	スイス	IE	アイルランド	MW	マラウイ	UZ	ウズベキスタン
CI	コートジボアール	IL	イスラエル	MX	メキシコ	VN	ヴェトナム
CM	カメルーン	IN	インド	MZ	モザンビーク	YU	ユーゴスラヴィア
CN	中国	IS	アイスランド	NE	ニジェール	ZA	南アフリカ共和国
CR	コスタ・リカ	IT	イタリア	NL	オランダ	ZW	ジンバブエ
CU	キューバ	JP	日本	NO	ノルウェー		
CY	キプロス	KE	ケニア	NZ	ニュージーランド		
CZ	チェコ	KG	キルギスタン	PL	ポーランド		
DE	ドイツ	KP	北朝鮮	PT	ポルトガル		
DK	デンマーク	KR	韓国	RO	ルーマニア		

(19) 日本国特許庁 (J P)

## (12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開2003-286263

(P2003-286263A)

(43) 公開日 平成15年10月10日 (2003. 10. 10)

(51) Int.Cl. <sup>7</sup>	識別記号	F I	テーマコード*(参考)
C 0 7 D 215/22		C 0 7 D 215/22	4 C 0 3 1
A 6 1 K 31/47		A 6 1 K 31/47	4 C 0 6 3
31/4709		31/4709	4 C 0 8 6
31/517		31/517	
31/5377		31/5377	

審査請求 未請求 請求項の数52 O L (全 99 頁) 最終頁に続く

(21) 出願番号	特願2003-128216(P2003-128216)	(71) 出願人	000253503
(62) 分割の表示	特願2000-594782(P2000-594782) の分割		麒麟麦酒株式会社
(22) 出願日	平成12年1月20日 (2000. 1. 20)		東京都中央区新川二丁目10番1号
(31) 優先権主張番号	特願平11-14858	(72) 発明者	久保和生
(32) 優先日	平成11年1月22日 (1999. 1. 22)		群馬県高崎市中居町4-17-9 キリン中居寮207号室
(33) 優先権主張国	日本 (J P)	(72) 発明者	藤原康成
(31) 優先権主張番号	特願平11-26691		群馬県高崎市宮原町12-210
(32) 優先日	平成11年2月3日 (1999. 2. 3)	(72) 発明者	磯江敏幸
(33) 優先権主張国	日本 (J P)		群馬県高崎市台新田町330-28
(31) 優先権主張番号	特願平11-142493	(74) 代理人	100075812
(32) 優先日	平成11年5月21日 (1999. 5. 21)		弁理士 吉武 賢次 (外3名)
(33) 優先権主張国	日本 (J P)		

最終頁に続く

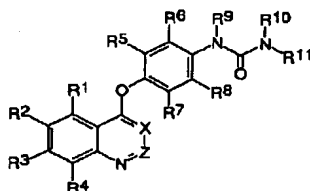
(54) 【発明の名称】 キノリン誘導体およびキナゾリン誘導体

## (57) 【要約】

【課題】 抗腫瘍活性を有しかつ細胞形態変化を生じさせない化合物の提供。

【解決手段】 式 (I) の化合物およびその薬学上許容される塩および溶媒和物並びにこの化合物を含む医薬組成物。

【化1】



(I)

(XおよびZはCHまたはNを表し、R<sup>1-3</sup>はH、置換アルコキシ、非置換アルコキシ等を表し、R<sup>4</sup>はHを表し、R<sup>5-8</sup>はH、ハロゲン、アルキル、アルコキシ、アルキルチオ、ニトロまたはアミノを表すが、R<sup>5-8</sup>が総てHを表すことはなく、R<sup>9</sup>およびR<sup>10</sup>はH、アルキル、アルキルカルボニルを表し、R<sup>11</sup>はアルキル、アルケニル、アルキニルまたはアラルキルを表す)